

# 特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第 12 条、法施行規則第 56 条)  
[PCT 36 条及び PCT 規則 70]



出願人又は代理人 の書類記号 664595	今後の手続きについては、様式 PCT/ I P E A / 4 1 6 を参照すること。	
国際出願番号 PCT/ J P 2 0 0 4 / 0 0 9 4 8 8	国際出願日 (日. 月. 年) 2 9 . 0 6 . 2 0 0 4	優先日 (日. 月. 年) 3 0 . 0 6 . 2 0 0 3
国際特許分類 ( I P C ) Int.Cl. <sup>7</sup> C07D405/14, 405/12, C07C229/48, 227/16, 211/45, 209/04, 253/14, 255/49//C07D307/85, 333/68, 213/81, 213/85		
出願人 (氏名又は名称) 田辺製薬株式会社		

<p>1. この報告書は、PCT 35 条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第 57 条 (PCT 36 条) の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>6</u> ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a. <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で <u>        </u> ページである。</p> <p><input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙 (PCT 規則 70. 16 及び実施細則第 607 号参照)</p> <p><input type="checkbox"/> 第 I 欄 4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b. <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で <u>        </u> (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。(実施細則第 802 号参照)</p> <p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第 I 欄 国際予備審査報告の基礎</p> <p><input type="checkbox"/> 第 II 欄 優先権</p> <p><input type="checkbox"/> 第 III 欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第 IV 欄 発明の単一性の欠如</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第 V 欄 PCT 35 条 (2) に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明</p> <p><input type="checkbox"/> 第 VI 欄 ある種の引用文献</p> <p><input type="checkbox"/> 第 VII 欄 国際出願の不備</p> <p><input type="checkbox"/> 第 VIII 欄 国際出願に対する意見</p>
--

国際予備審査の請求書を受理した日 1 7 . 0 1 . 2 0 0 5	国際予備審査報告を作成した日 2 0 . 0 5 . 2 0 0 5	
名称及びあて先 日本国特許庁 ( I P E A / J P ) 郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5 東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号	特許庁審査官 (権限のある職員) 安川 聡	4 C 3 0 3 9
電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 5 2		

様式 PCT/ I P E A / 4 0 9 (表紙) (2004 年 1 月)

BEST AVAILABLE COPY

## 第 I 欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、\_\_\_\_\_ 語による翻訳文を基礎とした。  
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査  
☐ PCT規則12.4にいう国際公開  
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

## 第IV欄 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☐ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☒ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

発明1：請求の範囲1  
発明2：請求の範囲2  
発明3：請求の範囲3  
発明4：請求の範囲4, 9, 10  
発明5：請求の範囲5  
発明6：請求の範囲6  
発明7：請求の範囲7  
発明8：請求の範囲8

上記発明1は、一般式[I]で示される化合物の製法に関しており、一方、上記発明2-8は、それぞれ、上記製法における中間体が包含される一般式を有する化合物の製法に関する。

化合物[XV]と化合物[VIII]がそれぞれ公知の化合物であることなどを考慮すると(下記文献等参照)、発明1の「特別な技術的特徴」は、最終工程で、化合物[XV]と化合物[VIII]を反応させて、一般式[I]で示される化合物を合成する点にあるものと認められる。そして、発明2-8は、それぞれ特定の反応により、特定の化合物を合成する点に「特別な技術的特徴」があると認められる。

よって、上記発明1-8は、それぞれ互いに、一又は二以上の同一又は対応する特別な技術的特徴を含む技術的な関係にはなく、単一の一般的発明概念を形成するように連関しているものとは認められない。

したがって、本願の請求の範囲には、上記8個の連関していない発明が含まれるものと認められる。

文献：WO 99/14191 A1 (BIOCRYST PHARMACEUTICALS, INC.) 1999.03.25, 第14頁 Scheme1 参照

VITI, G. et al, Synthesis of new arylbenzofurodiazepin-6-ones, Journal of Heterocyclic Chemistry, 1990, Vol. 27, No. 5, p. 1369-75, 第1369頁 Scheme1 参照

4. したがって、国際出願の次の部分について、この報告を作成した。

☒ すべての部分

☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ に関する部分

BEST AVAILABLE COPY

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、  
それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1, 7	有
	請求の範囲	2-6, 8-10	無
進歩性 (IS)	請求の範囲	1	有
	請求の範囲	2-10	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-10	有
	請求の範囲		無

## 2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

- 文献 1 : DJAKOVITCH, L. et al, Amination of aryl bromides catalyzed by supported palladium, Journal of Organometallic Chemistry, 1999, Vol. 592, No. 2, p. 225-234
- 文献 2 : WO 99/14191 A1 (BIOCRYST PHARMACEUTICALS, INC.) 1999. 03. 25
- 文献 3 : JP 57-122062 A (日本ケミファ株式会社) 1982. 07. 29
- 文献 4 : INGOLD, K. U. et al, Cycloalkylmethyl radicals. Part 3. Dynamic stereochemistry of axial and equatorial cyclohexylmethyl and 4-alkylcyclohexylmethyl radicals, Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 2: Physical Organic Chemistry, 1972-1999, (1986), No. 8, p. 1337-44
- 文献 5 : JP 2001-039938 A (東ソー株式会社) 2001. 02. 13
- 文献 6 : VITI, G. et al, Synthesis of new arylbenzofurodiazepin-6-ones, Journal of Heterocyclic Chemistry, 1990, Vol. 27, No. 5, p. 1369-75
- 文献 7 : HARRISON, C. R. et al, Preparation of alkyl chlorides, acid chlorides, and amides using polymer-supported phosphines and carbon tetrachloride: mechanism of these reactions, Journal of Organic Chemistry, 1983, Vol. 48, No. 21, p. 3721-8

## ○請求の範囲 2 について

国際調査報告において引用された上記文献 1 には、本願請求の範囲 2 に係る反応と同一の反応が記載されており (第 226 頁 Scheme1 参照)、請求の範囲 2 に係る発明は、上記文献 1 に対して新規性、進歩性を有さない。

## ○請求の範囲 3 について

国際調査報告において引用された上記文献 2 には、本願請求の範囲 3 に係る反応と同一の反応が記載されており (第 14 頁 Scheme1 参照)、請求の範囲 3 に係る発明は、上記文献 2 に対して新規性、進歩性を有さない。

BEST AVAILABLE COPY

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

## ○請求の範囲 4, 9, 10 について

接触還元によりベンゼン環をシクロヘキサンに変換することは、本願出願時に慣用の技術であり、例えば、国際調査報告において引用された上記文献 3 には、p-アミノ安息香酸を接触還元により 4-アミノシクロヘキサンカルボン酸に変換する反応が記載されている（第 3 頁実施例 1 参照）。

よって、請求の範囲 4, 9, 10 に係る発明は、上記文献 3 に対して新規性、進歩性を有さない。

## ○請求の範囲 5 について

国際調査報告において引用された上記文献 4 には、本願請求の範囲 5 に係る反応と同一の反応が記載されており（第 1343 頁右欄参照）、請求の範囲 5 に係る発明は、上記文献 4 に対して新規性、進歩性を有さない。

## ○請求の範囲 6 について

国際調査報告において引用された上記文献 5 には、本願請求の範囲 6 に係る反応と同一の反応が記載されており（【0033】 - 【0035】段落実施例 1 参照）、また、V I I I 属金属化合物を担体に担持させ得ることも記載されている（【0019】段落参照）。

よって、請求の範囲 6 に係る発明は、上記文献 5 に対して新規性、進歩性を有さない。

## ○請求の範囲 8 について

国際調査報告において引用された上記文献 6 には、本願請求の範囲 8 に係る反応と同一の反応が記載されており（第 1369 頁 Scheme1 参照）、請求の範囲 8 に係る発明は、上記文献 6 に対して新規性、進歩性を有さない。

BEST AVAILABLE COPY

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

## ○請求の範囲 7 について

本願請求の範囲 7 に係る発明は、国際調査報告で引用された文献 1 - 7 に記載されておらず、新規性を有する。

上記文献 6 には、請求の範囲 7 の化合物[X I V]に対応する化合物（第 1369 頁 Scheme 2 a-f）が記載されている。

上記文献 6 においては、本願請求の範囲 7 に記載の反応とは異なる反応により、化合物[X I V]を合成しているが、上記文献 7 には、phenoxyacetic acid を塩素化し、aniline と反応させることによって phenoxyacetanilide を合成することが記載されており、上記文献 6 に記載の発明においても、同様の反応によって、上記化合物を合成することは、当業者が容易になし得た事項と認められる。

そして、その効果が格別であるとも認められない。

よって、請求の範囲 7 に係る発明は、上記文献 6, 7 に対して進歩性を有さない。

## ○請求の範囲 1 について

本願請求の範囲 1 に記載の発明は、国際調査報告で引用された文献 1 - 7 に記載されておらず、新規性を有する。

化合物[X V]と化合物[V I I I]を反応させて、一般式[I]で示される化合物を合成することは、何れの文献にも記載も示唆もされておらず、その点は当業者といえども自明のものではないことから、請求の範囲 1 に係る発明は、上記文献 1 - 7 に対して進歩性を有する。

BEST AVAILABLE COPY